

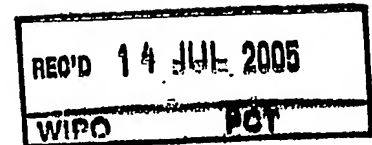
特許協力条約

PCT

特許性に関する国際予備報告（特許協力条約第二章）

（法第12条、法施行規則第56条）

〔PCT36条及びPCT規則70〕



出願人又は代理人 の書類記号 P04-095PCT	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP2004/009384	国際出願日 (日.月.年) 25.06.2004	優先日 (日.月.年) 26.06.2003
国際特許分類 (IPC) Int.Cl. ⁷ C07C229/50, A61K31/198, 31/216, 31/381, A61P25/12, 25/14, 25/16, 25/24, 25/28, 25/30, 43/00, C07C233/81, 317/48, 323/61, C07D333/18		
出願人 (氏名又は名称) 大正製薬株式会社		

<p>1. この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。 法施行規則第57条（PCT36条）の規定に従い送付する。</p> <p>2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で <u>4</u> ページからなる。</p> <p>3. この報告には次の附属物件も添付されている。</p> <p>a. <input type="checkbox"/> 附属書類は全部で _____ ページである。</p> <p><input type="checkbox"/> 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙（PCT規則70.16及び実施細則第607号参照）</p> <p><input type="checkbox"/> 第I欄4.及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙</p> <p>b. <input type="checkbox"/> 電子媒体は全部で _____ (電子媒体の種類、数を示す)。 配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。(実施細則第802号参照)</p> <p>4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第I欄 国際予備審査報告の基礎</p> <p><input type="checkbox"/> 第II欄 優先権</p> <p><input type="checkbox"/> 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成</p> <p><input type="checkbox"/> 第IV欄 発明の単一性の欠如</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明</p> <p><input type="checkbox"/> 第VI欄 ある種の引用文献</p> <p><input type="checkbox"/> 第VII欄 国際出願の不備</p> <p><input type="checkbox"/> 第VIII欄 国際出願に対する意見</p>	
--	--

国際予備審査の請求書を受理した日 25.04.2005	国際予備審査報告を作成した日 28.06.2005	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 吉良 優子	4H 3036
電話番号 03-3581-1101 内線 3443		

様式PCT/IPEA/409 (表紙) (2004年1月)

第 I 欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、_____ 語による翻訳文を基礎とした。
それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

- ☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査
☐ PCT規則12.4にいう国際公開
☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 _____ ページ、出願時に提出されたもの
 第 _____ ページ*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの
 第 _____ ページ*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 _____ 項、出願時に提出されたもの
 第 _____ 項*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの
 第 _____ 項*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの
 第 _____ 項*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 _____ ページ/図、出願時に提出されたもの
 第 _____ ページ/図*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの
 第 _____ ページ/図*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 第 _____ ページ/図
☐ 配列表(具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) _____

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 第 _____ ページ/図
☐ 配列表(具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) _____

* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲 2-23	有
	請求の範囲 1, 24, 25	無
進歩性 (I S)	請求の範囲	有
	請求の範囲 1-25	無
産業上の利用可能性 (I A)	請求の範囲 1-25	有
	請求の範囲	無

2. 文献及び説明 (PCT規則 70.7)

文献1:JP 2000-86597 A(エフ・ホフマン・ラ ロシュ アーゲー)2000.03.28,

特許請求の範囲, 例28, 30, 31

文献2:WO 02/68380 A1(ELI LILLY AND COMPANY)2002.09.06, Claims

文献3:JP 2001-525825 A(イーライ・リリー・アンド・カンパニー)2001.12.11, 特許請求の範囲

文献4:JP 2000-500754 A(イーライ・リリー・アンド・カンパニー)2000.01.25, 特許請求の範囲

文献5:JP 2000-336071 A(大正製薬株式会社)2000.12.05, 特許請求の範囲, 【0004】, 【0104】

(1)請求の範囲1、24、25に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献1から新規性及び進歩性を有さない。

請求の範囲2～4、6に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献1から進歩性を有さない。

文献1には、(1S, 2R, 3S, 5R, 6S) - 2, 3-ジアミノ-ピシクロ[3. 1. 0]ヘキサン-2, 6-ジカルボン酸がグループIIのメタボトロピックグルタメートレセプタに対するリガンドであって、該レセプタ機能の調節に有用であることが記載されている。

そして、そもそも、本願発明の化合物群は、文献1に記載の化合物を含むものであり、出願人が答弁書において主張する本願発明の効果は、上記新規性判断を左右しない。

また、アミノ基の結合する3位の不斉炭素をR体に換えてみることは、当業者が適宜行うことであり、特にR体にしたことによって予測し得ない効果を奏しているとも認められない。

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 V.2 欄の続き

(2) 請求の範囲1～25に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献1～5から進歩性を有さない。

文献1には、3位の位置にアミノ基やアルコキシ基等の置換基を有する2-アミノ-ピシクロ[3. 1. 0]ヘキサン-2, 6-ジカルボン酸誘導体が、グループ II のメタボトロピックグルタメートレセプタに対するリガンドであって、該レセプタ機能の調節に有用であることが記載されている。

これに対して、本願発明の化合物は、3位の置換基の構造が、文献1に記載の化合物と相違する。

しかしながら、文献2～5には、文献1と同じ活性かつ同じ骨格を有する、2-アミノ-ピシクロ[3. 1. 0]ヘキサン-2, 6-ジカルボン酸誘導体が記載され、4位の位置に本願発明の3位の置換基と同じ構造の基が記載されている。そして、特に、文献2、5に記載の化合物は、4位の置換基として、本願発明の3位の置換基と同じ構造の基の他に、文献1に記載の化合物の3位の置換基と同じアルコキシ基も有することができることが記載されていることも勘案すると、2-アミノ-ピシクロ[3. 1. 0]ヘキサン-2, 6-ジカルボン酸の3位または4位の置換基は、類似する構造を有することができることが、容易に予測できる。すなわち、文献1に記載の3位の置換基として、文献2～5に記載の4位の置換基を採用しても活性を失わないことは、当業者が容易に想到し得たことである。

さらに、本願発明の化合物は2-アミノ-ピシクロ[3. 1. 0]ヘキサン-2, 6-ジカルボン酸の6位の位置に弗素を有していてもよい。しかしながら、文献5には、文献1と同じ2-アミノ-ピシクロ[3. 1. 0]ヘキサン-2, 6-ジカルボン酸骨格の化合物の6位の位置に弗素を結合させて、化合物の吸収性、代謝安定性、薬理効果を高める試みがなされているから、文献1に記載の化合物も、6位の位置に弗素を結合させてみることは、当業者が適宜行うことで、格別の創意を要しない。

ここで、出願人は、答弁書において、本願発明の化合物が阻害活性を示すことを予測できないと主張する。しかしながら、文献1～5の記載から、2-アミノ-ピシクロ[3. 1. 0]ヘキサン-2, 6-ジカルボン酸構造が阻害活性に関係することを、当業者は容易に予測できるし、特に本願発明の化合物が、文献1～5に記載の化合物に比べて、予測し得ない程の阻害活性を示しているとも認められない。このため、該出願人の主張は、上記進歩性の判断を左右するものではない。